

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**



(1,000円)

特許署

昭和49年5月22日

特許庁長官 聲

4. 発明の名称  
置換酢酸誘導体の製造法

2. 発明者

アマガキレムコクカマチ  
兵庫県尼崎市武庫塩町2の5の53の303  
ハマ タ ミシノリ  
浜田 芳徳 (ほか1名)

3. 特許出願人 郵便番号 541

アマガキレムコクカマチ  
大阪府大阪市東区道修町3丁目13番地  
シオノ ザイタク  
(1931) 塩野義製薬株式会社  
代表者 吉利雄

4. 代理人 郵便番号 553

大阪市福島区鷺洲上2丁目47番地  
塩野義製薬株式会社特許部(電話06-438-5861)  
弁理士(6703) 岩崎光隆  
添付書類の目録

明細書 / 適

委任状 / 適

(3) 願書副本 49-058244 / 適



⑯ 日本国特許庁

## 公開特許公報

⑰ 特開昭 50-149668

⑱ 公開日 昭50.(1975)11.29

⑲ 特願昭 49-58244

⑳ 出願日 昭49.(1974)5.22

審査請求 未請求 (全8頁)

厅内整理番号 5627 44

6762 44  
7306 44  
5627 44

㉑ 日本分類

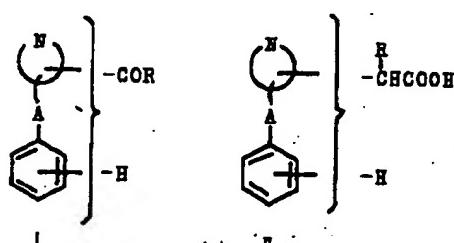
16 E25/1  
16 E23/1  
30 B6  
30 C0㉒ Int.Cl<sup>2</sup>C07D277/34  
C07D277/36  
C07D277/38  
C07D277/42  
C07D213/62  
C07D213/741  
A61K 31/425  
A61K 31/44

び上記ベンゼン環は反応に影響を及ぼさない(～3個の置換基を有していてもよくあるいは結合ベニゼン環または結合誘導体を有していてもよく-COR基はこの結合ベンゼン環上にあってよい。但し○がチャゾールでない場合は、△は酸素または硫黄を表す。)

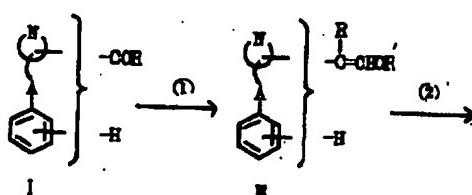
## ㉓ 発明の詳細な説明

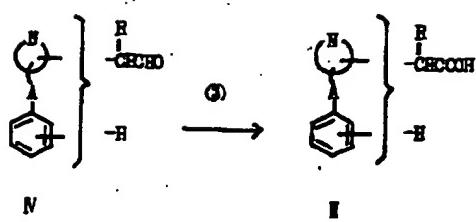
本発明は置換酢酸誘導体の製造法に関し、その目的は優れた抗炎症作用(抗リウマチ作用も含む)および鎮痛作用を示し医薬または動物薬として有用な置換酢酸誘導体を得る点にある。

本発明方法の要旨は次式によつて示される。



〔式中、○はピリジン、ピリミジン、イミダゾール、テトラゾールまたはテアゾールを表わし、Rは炭化水素基を表わし、△は酸素、硫黄、イミノまたは炭化水素置換イミノ基を表わし、□およ





(式中、○はピリジン、ピリミジン、イミダゾール、テトラゾールまたはチアゾールを表わし、Rは炭化水素基を表わし、Aは酸素、硫黄、イミノ基または炭化水素置換イミノ基を表わし、○および上記ベンゼン環は反応に影響を及ぼさないノ～3個の置換基を有していてもよくあるいは結合ベンゼン環または結合脂環を有していてもよい。  
-COH基はこの結合ベンゼン環上にあってもよい。  
Rはアルキル基を表わす。但し○がチアゾールでない場合は、Aは酸素または硫黄を表わす。)

本発明方法は一般式Iで表わされる化合物をアルコキシメチレン三炭化水素置換フオスフォランと反応させりいわゆるウィッティヒ(Wittig)反応に付し(反応①)、得られる化合物IIを加水分

- 3 -

反応させるのが通常実務的である。反応は通常不活性気流中で行われる。得られる化合物IIはついで反応②すなわち加水分解反応に付し、アルコキシメチレン基をアルデヒド基にする。この加水分解は通常エノールエーテルを加水分解する際に用いられる手段を用いることができる。例えば、酸として塩酸、硫酸、硝酸またはこれらと有機酸(例えば、酢酸)などとの混合物を用いることができ、塩基として水酸化アルカリ、炭酸アルカリなどが用いられ水あるいは含水溶媒の存在下で加熱することにより実施される。生成する化合物IIIは単離することなく次工程③に付すことができる。

反応③は化合物IIのアルデヒド基をカルボキシル基に変えるもので一般的アルデヒド基をカルボキシル基に置換する酸化反応に準じて行えばよい。例えば過マンガン酸カリウム、過酸化水素、酸化銀などにより水中または有機溶媒中で酸化してもよいし、硝酸、クロム酸、過硫酸と過酸化鉄、または過酸化酢酸などにより酸化してもよい。なお上記反応①、②および③の工程において反応を受

特開昭50-149668 ②  
群に付し化合物IIとした(反応③)後酸化反応に付して目的とする置換酢酸導体IIを得る(反応④)ものである。

次に本発明方法の実施について詳細に記する。反応①は通常のウィッティヒ反応に従つて行えばよく、種々のアルコキシメチレン三炭化水素置換フオスフォラン(例えば、メトキシメチレントリフェニルフオスフォラン、メトキシメチレントリメトキシメチル)フオスフォラン、エトキシメチレントリブチルフオスフォランなど)が原料化合物と反応条件に応じて適宜選択し使用される。例えば、上記フオスフォランにハロゲン化水素が付加したフオスフォニウム塩を使用し、有機金属(例えば、フェニルリチウム、ブチルリチウムなど)を用いてエーテル環(例えば、エーテル、ジビニルエーテル、テトラヒドロフランなど)中で必要に応じて加温下で化合物Iと反応させるか、あるいはアルカリ金属アルコキサイド(例えば、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラートなど)を用いアルコキサイドと対応するアルコール中で

- 4 -

ける環上の置換基は各反応の前後に置換基を修飾することにより、最終において目的化合物を得るようにすることができる。

かくして得られた化合物IIはさらに分離、精製あるいは製剤化、その他の必要に応じて、適當なアルカリ金属塩(例えば、ナトリウム、カリウムなど)、アルカリ土類金属塩(例えば、カルシウム、マグネシウム、バリウムなど)、その他アルミニウム塩などに常法に従つて変換することができる。

本発明方法の目的化合物である置換酢酸導体及びその複数は優れた抗炎症作用(抗リウマチ作用も含む)または鎮痛作用を示し、医薬または動物薬として有用な化合物である。

以下実施例において本発明方法の実施態様を示す。

#### 実施例1

粉末にしたメトキシメチレントリフェニルフオスフォリウムクロライドヨコヨウリをエーテル240mlに溶解し、内温15～20℃で1/25

モルフエニルリチウムエーテル溶液 6.0 ml を滴下後、5°Cで15分間かきませる。ユーフエノキシ-5-アセチルピリジンクノキのエーテル溶液 14.0 ml を30分で滴下後室温で14時間かきませる。不溶物を沪去し沪液に冰水を注ぎエーテルで抽出する。抽出液を水洗、乾燥後溶媒を留去し残渣 2.62 g をシリカゲルカラムクロマトに付す。ベンゼン/酢酸エチル(50:1)溶出部を減圧蒸留すると bp<sub>40-45°C</sub> 142~149°C のユーフエノキシ-5-(1-メチル-2-メトキシビニル)ピリジン 2.2 g を得る。

元素分析 C<sub>13</sub>H<sub>15</sub>O<sub>2</sub>N として

計算値: C, 74.66; H, 6.27; N, 5.89

実験値: C, 74.94; H, 6.37; N, 5.79

IR ν<sub>max</sub><sup>CHCl<sub>3</sub></sup> cm<sup>-1</sup> 1658, 1590

NMR δ(CDCl<sub>3</sub>) 1.88, 1.95(3H, d), 1.367, 2.70(3H, s), 4.12, 6.33(3H, q)

本品 2.2 g を 2 M 塩酸 5.0 ml に加え、窒素気流中一夜かきませた後反応液にベンゼン 1.0 ml を入れ窒素気流中温マンガン酸カリウム 1.3 g の水

### 開昭50-149668 (3)

溶液 3.0 ml を 20 分で滴下さらに室温で 10 分間かきませた後不溶物を沪去し沪液を炭酸水素ナトリウムで pH 3~4 としてエーテルで抽出する。抽出液を 5% 炭酸水素ナトリウム水溶液で抽出し 1.0 M 塩酸で pH 4 とした後エーテルで再び抽出する。抽出液を水洗、乾燥し溶媒を留去する。残渣 61.0 mg をベンゼン/石油エーテルで再結晶すると mp 88~90°C のユーフエノキシ-5-(1-メチル-2-メトキシビニル)プロピオン酸 21.0 mg を得る。本品は他の方法により調製された標品と同定された。

#### 実験例 2

以下実験例 1 と同様にして下記の化合物を得る。なお、下記表中で用いられる略号は下記の意味を表わし、X<sub>1</sub> において例えば Y-0 はピリジン環の 3 位がエーテル結合していることを表わし、X<sub>1</sub>-Y<sub>1</sub>-Y<sub>2</sub> および Y<sub>3</sub> において例えば n-C<sub>4</sub> はクロルが母核の 6 位を置換していることを表わす。

Me: メチル基 Met: メトキシ基 Et: エチル基

Iso-Bu: イソブチル基 Ac: アセチル基 An: アニリン基

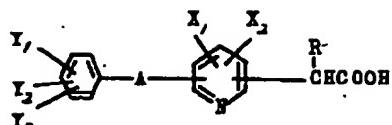
CH<sub>2</sub>-C≡C: シクロプロピルメチル基

- 8 -

Ca(nH<sub>2</sub>O): カルシウム塩 (n 水和物を表わす)

Al: アルミニウム塩 d: 分解点

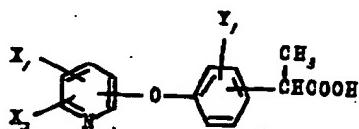
(以下余白)



実験例 No.	R -CHCOOH	R - A -	X <sub>1</sub>	X <sub>2</sub>	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	Y <sub>3</sub>	$\mp$ (°C)
2	3	Me 5-O	H	H	H	H	H	135~135.5
3	4	Me 2-O	H	H	4-C6	H	H	119~120d
4	4	Me 2-O	H	H	H	H	H	98~99.4
5	4	Me 2-O	H	H	2-C6	H	H	107.5~108.5d
6	4	Me 2-O	H	H	3-C6	H	H	84~85d
7	3	Me 2-O	H	H	4-C6	H	H	110~111
8	3	Me 2-O	H	H	H	H	H	94~95
9	3	Me 6-O	H	H	4-C6	H	H	114~115
10	2	Me 6-O	H	H	H	H	H	Ca(2H <sub>2</sub> O)135~136
11	2	Me 6-O	H	H	4-C6	H	H	Ca(2H <sub>2</sub> O)80~81d
12	4	Me 2-S	H	H	4-C6	H	H	186d~187
13	4	Me 2-O	H	H	4-Met.	H	H	129~130d
14	4	Me 2-O	H	H	4-Me	H	H	101~102d
15	3	Me 6-S	H	H	H	H	H	114.5~115.5
16	3	Me 6-O	H	H	4-Me	H	H	98~99
17	4	Me 2-S	H	H	H	H	H	Ca(2H <sub>2</sub> O)140~141
18	3	Me 6-O	H	H	4-Met	H	H	Ca(4H <sub>2</sub> O)155
19	4	Et 2-O	H	H	4-C6	H	H	9.2~9.3
20	3	Me 6-O	H	H	3-C6	H	H	106~107
21	4	Me 2-O	H	H	4-CH	H	H	103~106d
22	3	Et 6-O	H	H	4-C6	H	H	182.36
23	4	Me 2-O	H	H	4-COOH	H	H	158~156d
24	4	Me 2-O	H	H	3-CF <sub>3</sub>	H	H	Ca(2H <sub>2</sub> O)155~157
25	3	Me 6-S	H	H	4-C6	H	H	Ca(H <sub>2</sub> O)150
26	4	Me 2-O	H	H	4-COOH <sub>2</sub>	H	H	160~162 (発泡) 200~201
27	4	Me 2-O	H	H	4-OH	H	H	Ca(4H <sub>2</sub> O)187~189
28	4	Me 2-O	H	H	4-OAc	H	H	Ca(2H <sub>2</sub> O)132.5~133.5
29	3	Me 6-O	H	H	4-OAc	H	H	Ca(4H <sub>2</sub> O)145
30	3	Me 6-O	H	H	4-OH	H	H	Ca(H <sub>2</sub> O)205
31	4	Me 2-O	H	H	4-NO <sub>2</sub>	H	H	115~116d
32	4	Me 2-O	H	H	4-NH <sub>2</sub>	H	H	132~133d
33	4	Me 2-O	H	H	4-NHAc	H	H	142~143d
34	4	Me 2-O	H	H	4-NHCOOEt	H	H	136~137d

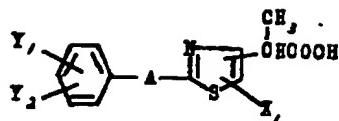
実験例 No	R - A - の位置	X <sub>1</sub>	X <sub>2</sub>	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	Y <sub>3</sub>	mp(°C)
35	4 Me 2-0	H	H	4-MeO- 2-Br	H	H	206~208d
36	3 Me 4-0	H	H	4-Br	H	H	119~120
37	4 Me 3-0	H	H	3,4-ベンジ	H	H	138~139d
38	3 Me 6-0	H	H	6-CH <sub>3</sub>	H	H	120~121
39	3 Me 6-0	4-Me	H	H	H	H	135~136
40	3 Me 6-0	2-Me	H	H	H	H	92~93
41	3 Me 6-0	H	H	2-Me	3-Me	H	115~116
42	3 Me 6-0	H	H	3-C <sub>6</sub>	H	H	96~97
43	3 Me 6-0	H	H	3-Me	H	H	65~67
44	3 Me 6-0	H	H	3-Me	H	H	81~82
45	3 Me 6-0	H	H	3-Me	s-Me	H	120~121
46	3 Me 6-0	H	H	3-Me	4-Me	H	90~91
47	3 Me 4-0	H	H	H	H	H	145~146
48	3 Me 4-0	H	H	4-iso-Bu	H	H	77~78
49	4 Me 2-0	H	H	2-Me	3-Me	H	86~87d
50	3 Me 6-0	2-Me	H	H	H	H	107~108
51	3 Me 6-0	H	H	2-Me	3-Me	H	Ca(2H <sub>2</sub> O)195d
52	3 Me 6-0	H	H	2-Me	4-Me	H	Ca(2H <sub>2</sub> O)189d
53	3 Me 4-0	H	H	2-Me	4-Me	H	Ca(1.5H <sub>2</sub> O)202d
54	4 Me 2-0	H	H	3-Me	4-Me	H	123~124d
55	4 Me 2-0	H	H	3-Me	5-Me	H	103~104d
56	3 Me 6-0	H	H	2-Me	3-Me	s-Me	128~129
57	3 Me 6-0	H	H	2-Me	4-Me	s-Me	113~114
58	3 Me 6-0	H	H	3-Me	4-Me	s-Me	155~156
59	3 Me 6-0	H	H	2-Me	4-Me	6-Me	135~136
60	3 Me 6-0	H	H	2,4-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	H	Ca(1.5H <sub>2</sub> O)169d	
61	4 Me 2-0	H	H	2-Me	3-Me	s-Me	125~126d
62	4 Me 2-0	H	H	3-Me	4-Me	s-Me	126~127d
63	3 Me 6-0	H	H	2,3-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	H	Ca(1.5H <sub>2</sub> O)169~168d	
64	3 Me 6-0	H	H	3,4-ベンジ	H	H	1205~1215
65	3 Me 6-0	H	H	2,3-ベンジ	H	H	131~132
66	3 Me 6-0	4-Me	3-Me	H	H	H	148~149
67	4 Me 2-0	3,6-C <sub>6</sub>	H	H	H	H	Ca(1.5H <sub>2</sub> O)216~217
68	3 Me 6-0	9,5-ベンジ	H	H	H	H	122~123
69	3 Me 6-0	4,5-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	H	H	H	H	151~152
70	3 Me 6-0	H	H	2,4-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	H	H	1225~1235

実験例 No.	R	-A-	X <sub>1</sub>	X <sub>2</sub>	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	Y <sub>3</sub>	mp(°C)
	-CH <sub>2</sub> COOH							
71	3	Me	6-O	H	H	3-Me	H	62.5~70.5
72	3	Me	6-O	2-Me	4-Me	H	H	Cal(H <sub>2</sub> O) 21.8d
73	3	Me	6-O	H	H	6-OH	H	167~169
74	3	Me	6-O	H	H	6-NO <sub>2</sub>	H	161~162

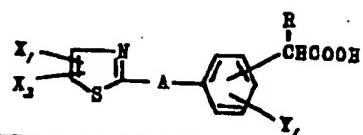


実験例 No.	X <sub>1</sub>	X <sub>2</sub>	ブエノキシ基 の位置	Y <sub>1</sub>	R	-CH <sub>2</sub> COOH の位置	mp(°C)
75	H	H	2	H	3	76~77	
76	H	H	2	H	4	129~130	
77	S-OH	H	2	H	4	198~200	
78	S-COOH <sub>2</sub>	H	2	H	4	211~212	
79	H	H	3	H	4	130~131	
80	H	H	4	H	4	180~181	
81	3,4-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		2	H	4	166~167	
82	3,4-ベンゾ		2	H	4	145~147	
83	3-Me	4-Me	2	H	4	155.5~156	
84	4-Me	5-Me	2	H	4	142~143	
85	4-Me	H	2	H	4	123~124	
86	6-Me	H	2	H	4	Cal(H <sub>2</sub> O) 273~275	
87	3-Br	H	2	H	4	137~138	
88	2-Me	H	4	H	4	152~153	
89	S-Me	H	2	H	4	132~134	
90	3-Me	H	2	H	4	121~122	
91	H	H	2	2-Me	4	107~108	
92	H	H	2	2-Met	4	Cal(H <sub>2</sub> O) 158d	
93	※1	H	2	H	4	136~138	

※1 S-CH<sub>2</sub>COOH



実験例 No.	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	A	Z <sub>1</sub>	CH <sub>3</sub> -C(=O)COOH の位置	T(°C)
94	H	H	O	4-Me	S	110~111
95	2-Me	3-Me	O	4-Me	S	142~143
96	3-CP <sub>3</sub>	H	O	4-Me	S	Cal(15H <sub>2</sub> O)/106d
97	4-Me	H	O	4-Me	S	118. Cal(25H <sub>2</sub> O)/46d
98	4-CS	H	O	4-Me	S	93~94. Cal(25H <sub>2</sub> O)/33
99	H	H	S	4-Me	S	128~130
100	H	H	O	H	S	Cal(15H <sub>2</sub> O)/69~70d
101	4-CS	H	O	H	S	Cal(H <sub>2</sub> O)/45d
102	H	H	NH	4-Me	S	145d
103	3-CP <sub>3</sub>	H	NH	4-Me	S	195d
104	H	H	O	H	K	Cal(15H <sub>2</sub> O)/62d
105	H	H	O	3-Me	K	Cal(25H <sub>2</sub> O)/42d
106	4-CS	H	O	H	K	Cal(25H <sub>2</sub> O)/33~35d
107	4-OI	H	O	5-Me	K	Cal(25H <sub>2</sub> O)/34~36
108	H	H	H-Me	H	K	29~80d
109	H	H	H-Me	4-Me	S	141~142
110	H	H	H-79ル	4-Me	S	106~107
111	H	H	H-CH <sub>3</sub> -4-Me	H	S	120~121
112	H	H	H-Me	H	S	198~200
113	H	H	H-79ル	H	S	136~135
114	H	H	H-CH <sub>3</sub> -Q	H	K	Cal(9H <sub>2</sub> O)/80~83
115	H	H	H-79ル	H	K	Cal(H <sub>2</sub> O)/20~25d
116	H	H	H-79ル	H	K	Cal(25H <sub>2</sub> O)/73~78d



実施例 No.	X <sub>1</sub>	X <sub>2</sub>	A	Y <sub>1</sub>	R-COOH の位置	R	$\eta^{\circ}$ (°C)
117	H	H	O	H	4	Me	119~120
118	4-Me	3-Me	O	H	4	Me	123~124
119	4-Me	H	O	H	4	Me	87~88
120	H	H	O	2-Me	4	Me	Ca(H <sub>2</sub> O) <sub>173d</sub>
121	H	H	O	H	4	アリル	Ca(H <sub>2</sub> O) <sub>134d</sub>
122	H	H	O	H	3	Me	88~89
123	H	H	H-Me	H	4	Me	123~124
124	H	H	H-アリル	H	4	Me	118~119
125	H	H	O	H	4	Et	115~116
126	H	H	O	H	4	ヘキシル	121~122
127	H	H	O	H	4	乙2	99~100
128	H	H	O	H	4	乙3	111~112
129	H	H	O	H	4	-CH <sub>2</sub> -4	85~86
130	H	H	O	2-Me	4	Me	93~94

※2 -CH<sub>2</sub>C≡OH※3 -CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)=CH<sub>2</sub>

- 14 -

## 実施例 131 ~ 134

実施例 1 と同様にして下記の化合物を得る。

2-[4-(4-メチルオキシ)エーナフチル]プロピオン酸、mp 197~198°C。

2-[4-(4-フェニル-1,2-エニルテトラゾリルオキシ)エニル]プロピオン酸、mp 165~166°C。

2-[4-(4-ビリジルオキシ)エニル]プロピオン酸、mp 124~125°C。

2-[4-(4-メチルエーベンズイミダゾイルオキシ)エニル]プロピオン酸、mp 184~185°C。

## △前記以外の発明者

サカイ・サンショウドオリ  
大阪府界市三条通2の5  
オカグチツオ  
岡田哲夫

特許出願人 植野製薬株式会社

代理人 弁理士 岩崎光隆



昭 53.11.18 発行

特許法第17条の2による補正の掲載

昭和49年特許願第58244号(特開昭

50-149668号 昭和50年11月29日

発行公開特許公報50-1497号(掲載)については特許法第17条の2による補正があったので下記の通り掲載する。

府内整理番号	日本分類
6762 44	16 E351
7306 44	16 E431
5647 44	30 B4
5647 44	30 C0

手続補正

←意見書に代えて→

昭和53年11月19日

特許庁長官 殿

1.事件の表示 昭和49年特許願第58244号

2.発明の名称

置換酢酸誘導体の製造法

3.補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 大阪府大阪市東区道修町3丁目12番地

名称 (192) 塩野義製薬株式会社

代表者 吉利一雄

4.代理人

住所 大阪市福島区鷺洲5丁目12番6号

塩野義製薬株式会社 特許部

(電話06-458-5861)

氏名 弁理士(6703) 岩崎光

→拒絶理由通知の日付 昭和 年 月 日(元第)

5.補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄

6.補正の内容

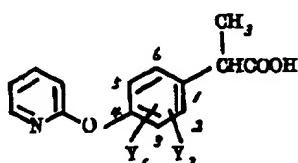
(1)明細書8頁11行目の「実施例2」を「実施例2-130」に訂正する。

(2)同書12頁実施例87のX欄の「3-Bz」を「5-Bz」に訂正する。

(3)同書15頁の実施例131~134の次に下記の実施例135~169を追加する。

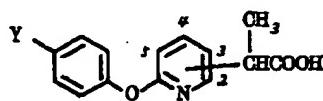
「実施例135~169

実施例1と同様に反応操作し、下記の化合物を得る。



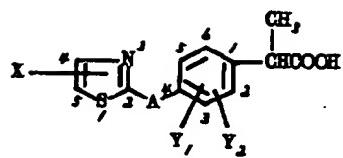
(以下余白)

実施例 No.	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	T <sub>d</sub> (°C)
135	2-Me	H	150~151
136	3-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	98~99
137	2-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	145~146
138	3-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	5-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	127~128



実施例 No.	Y	X	T <sub>d</sub> (°C)
139	i-Pr	3	59~71
140	Pr	3	81.5~82.5
141	t-Bu	3	112~113
142	s-Bu	3	67~71
143	Bu	3	Cs·H <sub>2</sub> O / 40~142
144	i-Bu	3	Cs / 114~119(d)

昭 53.11.18 発行



実験例 No.	X	A	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	T(°C)
145	H	O	2-Me	H	120~131
146	H	O	3-CF <sub>3</sub>	H	115~116
147	H	O	2-CF <sub>3</sub>	H	86~87
148	H	N-Me	3-CF <sub>3</sub>	H	C <sub>6</sub> :4E <sub>2</sub> O 175~178
149	H	S	H	H	85~87
150	H	O	2-CF <sub>3</sub>	3-Me	147~148
151	H	O	3-F	H	107~108
152	H	O	2-Me	5-CF <sub>3</sub>	130~131
153	H	NH	3-CF <sub>3</sub>	H	144~145
154	4-Me	NH	2-CF <sub>3</sub>	H	185~188
155	4-Me	NH	3-F	H	163~164
156	4-Me	NH	2-F	H	202~204
157	H	NH	2-Y	H	190~191.5
158	H	NH	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	177~178

159	4-Me	N-Me	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	138~139
160	4-Me	NH	3-Me	H	201~202
161	H	N-Me	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	180~181
162	H	N-Me	2-F	H	111~112.5
163	H	O	2-F	H	74~75
164	H	NH	3-F	H	160~161
165	H	N-Me	2-Me	H	165~166
166	H	N-Me	3-F	H	98~100
167	H	NH	2-CF <sub>3</sub>	H	174~175
168	H	NH	2-Me	H	160~161.5
169	H	N-Me	2-CF <sub>3</sub>	H	141~142

各表中の略号は以下の意味を表わす。

i-Pr:イソプロピル基 Pr:プロピル基

t-Bu:t-ブチル基 s-Bu:sec-tブチル基

i-Bu:イソブチル基。その他の略号は前記の意味を表わす。

以上